

na

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2000 年 12 月 14 日 (14.12.2000)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 00/74720 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 47/20, 47/36, 47/32, 47/38, 9/56

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/03770

(22) 国際出願日: 2000 年 6 月 9 日 (09.06.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願平 11/199409 1999 年 6 月 9 日 (09.06.1999) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 持田製薬株式会社 (MOCHIDA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒160-8515 東京都新宿区四谷1丁目7番地 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 工藤弓夫 (KUDO,

Yuimio) [JP/JP]. 植島浩貴 (UESHIMA, Hiroki) [JP/JP]. 酒井和家 (SAKAI, Kazuya) [JP/JP]; 〒160-8515 東京都新宿区四谷1丁目7番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 渡辺望稔, 外 (WATANABE, Mochitoshi et al.); 〒101-0032 東京都千代田区岩本町2丁目12番5号 早川トナカイビル3階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,

[続葉有]

(54) Title: SYSTEM FOR RELEASE IN LOWER DIGESTIVE TRACT

(54) 発明の名称: 消化管下部放出性システム

	a	b	c	d	e	f	g
	胃	十二指腸	空腸	回腸	盲腸	結腸	排出
	stomach	duodenum	jejunum	ileum	caecum	colon	excreta
4h	●●●						
6h	●●●						
8h	●	●	●				
10h				●	●●		
12h					●●●		
14h					●●●	●	
24h							●●●

h ● 腸溶性カプセル未崩壊  
i ○ 未変化のシームレスソフトカプセル  
j ● 褐色化したシームレスソフトカプセル  
k ● 黒色化したシームレスソフトカプセル (強度低下)  
l ● 破綻したシームレスソフトカプセル (内容物漏出)

a...STOMACH  
b...DUODENUM  
c...JEJUNUM  
d...ILEUM  
e...CECUM  
f...COLON  
g...EXCRETA  
h...ENTERIC CAPSULE (UNDISINTEGRATED)  
i...UNCHANGED SEAMLESS SOFTCAPSULE  
j...BROWN SEAMLESS SOFTCAPSULE  
k...BLACK SEAMLESS SOFTCAPSULE (DECREASED FILM STRENGTH)  
l...BROKEN SEAMLESS SOFTCAPSULE (LEAKAGE OF CONTENTS)

(57) Abstract: A system whereby a substance which is orally taken and to be delivered into the lower digestive tract is selectively delivered into the lower digestive tract. More particularly, a system which makes it possible to surely and quickly deliver the aimed substance to the lower digestive tract without being affected by pH change in the digestive tract due to change in bacterial flora. Compositions disintegrating in the lower digestive tract characterized by containing a compound <A>, which has a molecular weight of 1000 or less and has a disulfide bond, and a polymer <B>, which has a molecular weight exceeding 1000 and is digested by enteric bacteria and/or undergoes softening, swelling or dissolution due to a decrease in pH; molded products with the use of these compositions; and preparations with the use of these molded products.



WO 00/74720 A1

BEST AVAILABLE COPY



LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

— 国際調査報告書

(57) 要約:

本発明は、消化管下部に送達させたい物を経口的に摂取し消化管下部に選択的に送達するシステムを提供する。更に詳しくは、細菌叢の変動による消化管内pH変化の影響を受けず、確実かつ速やかに消化管下部選択的に目的物を送達させるシステムを提供する。また本発明は、分子量が1000以下で、ジスルフィド結合を有する化合物<A>と、分子量が1000超で、腸内細菌により分解される性質及び／またはpH低下により、軟化・膨潤ないしは溶解する性質を有する高分子<B>を含有することを特徴とする消化管下部崩壊性組成物、該組成物を用いた成形体、及び該成形体を用いた製剤を提供する。

BEST AVAILABLE COPY